

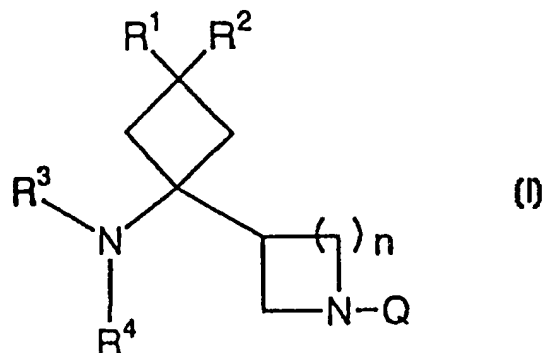


BEST AVAILABLE COPY

(51) 国際特許分類6 C07D 401/04, 498/06	A1	(11) 国際公開番号 WO98/54169 (43) 国際公開日 1998年12月3日(03.12.98)
(21) 国際出願番号 PCT/JP98/02359 (22) 国際出願日 1998年5月28日(28.05.98) (30) 優先権データ 特願平9/141398 1997年5月30日(30.05.97) JP (71) 出願人 (米国を除くすべての指定国について) 第一製薬株式会社 (DAIICHI PHARMACEUTICAL CO., LTD.)[JP/JP] 〒103-0027 東京都中央区日本橋三丁目14番10号 Tokyo, (JP) (72) 発明者; および (75) 発明者/出願人 (米国についてのみ) 竹村 真(TAKEMURA, Makoto)[JP/JP] 高橋 寿(TAKAHASHI, Hisashi)[JP/JP] 杉田和幸(SUGITA, Kazuyuki)[JP/JP] 宮内理江(MIYAUCHI, Rie)[JP/JP] 〒134-0081 東京都江戸川区北葛西一丁目16番13号 第一製薬株式会社 東京研究開発センター内 Tokyo, (JP)	(74) 代理人 弁理士 萩野 平, 外(HAGINO, Taira et al.) 〒107-6028 東京都港区赤坂一丁目12番32号 アーク森ビル28階 栄光特許事務所 Tokyo, (JP) (81) 指定国 AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CU, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, GB, GE, GH, GM, GW, HU, ID, IL, IS, JP, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZW, ARIPO特許 (GH, GM, KE, LS, MW, SD, SZ, UG, ZW), ユーロパ特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), 欧州特許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, ML, MR, NE, SN, TD, TG). 添付公開書類 国際調査報告書	

(54) Title: SUBSTITUTED CYCLOBUTYLAMINE DERIVATIVES

(54) 発明の名称 置換シクロブチルアミン誘導体

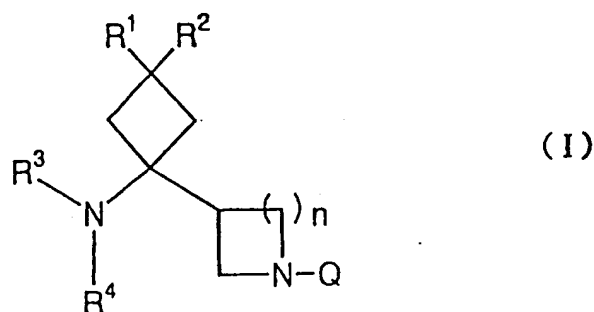


(57) Abstract

Substituted cyclobutylamine derivatives with novel structures represented by general formula (I), wherein R¹ to R⁴ and Q represent each a specific substituent and, in particular, Q represents a quinolone derivative of a specific structure. These derivatives are useful as antibacterial compounds which have excellent antibacterial actions over a wide scope of bacteria including gram-negative and gram-positive ones, exert potent antibacterial activities particularly on methicillin-resistant *Staphylococcus aureus* (MRSA), penicillin-resistant *Streptococcus pneumoniae* and quinolone-resistant bacteria and are excellent in the *in vivo* dynamics and safety.

(57)要約

本願発明化合物は、下記一般式 (I) で表される新規構造の置換シクロブチルアミン誘導体 ($R^1 \sim R^4$ 及び Q は、特定の置換基で、特に Q は、特定構造のキノロン誘導体を示す) であって、グラム陰性菌およびグラム陽性菌のいずれに対しても幅広い優れた抗菌力を有し、特にメチシリン耐性黄色ブドウ球菌 (MRSA)、ペニシリン耐性肺炎球菌、およびキノロン耐性菌に対しても強力な抗菌活性を示すとともに、良好な体内動態および安全性を兼ね備えており、有用な抗菌化合物を提供することができる。



PCTに基づいて公開される国際出願のパンフレット第一頁に掲載されたPCT加盟国を同定するために使用されるコード(参考情報)

AL	アルバニア	FI	フィンランド	LR	リベリア	SK	スロヴァキア
AM	アルメニア	FR	フランス	LS	レソト	SL	シネラ・レオネ
AT	オーストリア	GA	ガボン	LT	リトアニア	SN	セネガル
AU	オーストラリア	GB	英国	LU	ルクセンブルグ	SZ	スワジランド
AZ	アゼルバイジャン	GD	グレナダ	LV	ラトヴィア	TD	チャード
BA	ボスニア・ヘルツェゴビナ	GE	グルジア	MC	モナコ	TG	トーゴ
BB	バルバドス	GH	ガーナ	MD	モルドヴァ	TJ	タジキスタン
BE	ベルギー	GM	ガンビア	MG	マダガスカル	TM	トルクメニスタン
BF	ブルキナ・ファソ	GN	ギニア	MK	マケドニア旧ユーゴスラヴィア	TR	トルコ
BG	ブルガリア	GW	ギニア・ビサウ		共和国	TT	トリニダード・トバゴ
BJ	ベナン	GR	ギリシャ	ML	マリ	UA	ウクライナ
BR	ブラジル	HR	クロアチア	MN	モンゴル	UG	ウガンダ
BY	ベラルーシ	HU	ハンガリー	MR	モーリタニア	US	米国
CA	カナダ	ID	インドネシア	MW	マラウイ	UZ	ウズベキスタン
CF	中央アフリカ	IE	アイルランド	MX	メキシコ	VN	ヴェトナム
CC	コンゴ	IL	イスラエル	NE	ニジェール	YU	ユーゴスラビア
CH	スイス	IS	アイスランド	NL	オランダ	ZW	ジンバブエ
CI	コートジボアール	IT	イタリア	NO	ノルウェー		
CM	カメルーン	JP	日本	NZ	ニュージーランド		
CN	中国	KE	ケニア	PL	ポーランド		
CU	キューバ	KG	キルギスタン	PT	ポルトガル		
CY	キプロス	KP	北朝鮮	RO	ルーマニア		
CZ	チェコ	KR	韓国	RU	ロシア		
DE	ドイツ	KZ	カザフスタン	SD	スーダン		
DK	デンマーク	LC	セントルシア	SE	スウェーデン		
EE	エストニア	LI	リヒテンシュタイン	SG	シンガポール		
ES	スペイン	LK	スリ・ランカ	SI	スロヴェニア		